

## УД-23. ПОДХОДЫ К СИНТЕЗУ ПОЛИФТОРАЛКИЛ-4-АМИНОПИРАЗОЛОВ И ИХ БИОАКТИВНОСТЬ

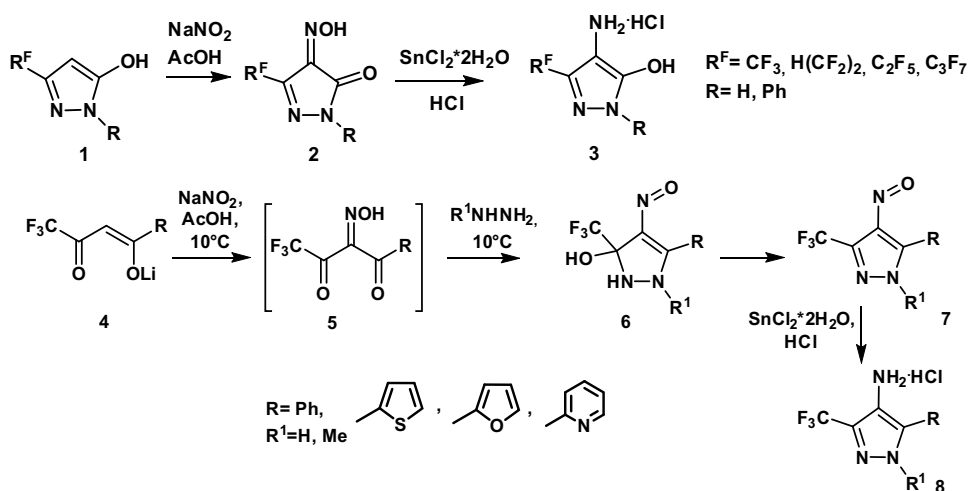
С. О. Куш, Н. А. Агафонова, Е. В. Щегольков, Я. В. Бургарт, В. И. Салоутин

Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,  
620990, Россия, Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22

E-mail: kushch.sv@gmail.com

Аминопиразольный скаффолд имеет большой потенциал для создания на его основе новых лекарственных средств с различными биологическими действиями.

Нами предложен подход к получению полифторалкил-4-аминопиразол-5-онов **3** путем восстановления 2-гидроксииминопиразол-5-онов **2** под действием  $\text{SnCl}_2$  в  $\text{HCl}$ . Для получения 2-гидроксииминопиразол-5-онов **2** эффективным оказалось нитрозирование 3-полифторалкилпиразол-5-онов **1**. Для синтеза полифторалкил-4-нитрозиопиразолов **7** разработан одnoreакторный метод, основанный на нитрозировании литиевых дикетонатов **4** и последующей циклизации промежуточных 2-гидроксиимино-1,3-дикетонатов **5** с гидразинами. При этом в ряде случаев выделены 3-гидроксипиразолины **6** как интермедиаты. Восстановление 4-нитрозиопиразолов **7** в гидрохлориды 4-аминопиразолов **8** реализовано с  $\text{SnCl}_2$ .



В опытах *in vitro* оценена туберкулостатическая, антибактериальная, антимикотическая, антиоксидантная, цитотоксическая активность синтезированных соединений; их анальгетическая активность и острая токсичность протестированна с помощью экспериментов *in vivo*.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (грант № 16-13-10255).